

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11)特許出願公表番号

特表平8-508270

(43)公表日 平成8年(1996)9月3日

4

(51)Int.Cl.*	識別記号	序内整理番号	F I
C 07 D 207/333	9159-4C	C 07 D 207/333	
A 61 K 31/34	9454-4C	A 61 K 31/34	
31/36	9454-4C	31/36	
31/40	9454-4C	31/40	
31/41	9454-4C	31/41	

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全181頁) 最終頁に統ぐ

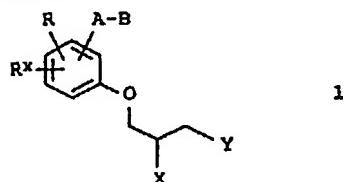
(21)出願番号	特願平6-521616	(71)出願人	ピーエーエスエフ アクチエンゲゼルシャフト
(36) (22)出願日	平成6年(1994)3月19日		ドイツ連邦共和国 D - 67056 ルートヴィッヒスハーフェン(番地なし)
(35)翻訳文提出日	平成7年(1995)9月29日	(72)発明者	ヤンセン、ベルント
(36)国際出願番号	PCT/EP94/00870		ドイツ連邦共和国 D - 67063 ルートヴィッヒスハーフェン ロイシュナーシュトラーセ 18ア-1
(37)国際公開番号	WO94/22842	(72)発明者	クリンク、アンドレアス
(37)国際公開日	平成6年(1994)10月13日		ドイツ連邦共和国 D - 68259 マンハイム ハウプトシュトラーセ 1
(31)優先権主張番号	08/038,706	(74)代理人	弁理士 矢野 敏雄 (外2名)
(32)優先日	1993年3月29日		
(33)優先権主張国	米国(US)		
(31)優先権主張番号	08/137,226		
(32)優先日	1993年10月18日		
(33)優先権主張国	米国(US)		

最終頁に統ぐ

(54)【発明の名称】マルチ・ドラッグ耐性のモジュレーターとしての1-アミノ-3-フェノキシプロパン誘導体

(57)【要約】

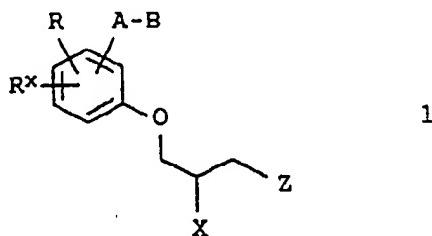
本発明は、式1:



〔式中、A、B、R、Rx、XおよびYは、明細書中の記載されたように定義されている〕で示される1-アミノ-3-フェノキシプロパン誘導体および該誘導体の製造法に関する。前記化合物は、癌の化学療法の場合のマルチ・ドラッグ耐性のモジュレーターとして使用することができ、かつマラリアの処置の場合の耐性を回避するため使用することができる。

## 【特許請求の範囲】

1 式 1 :

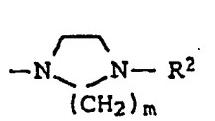


〔式中、

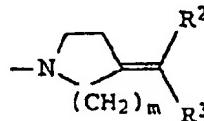
Xは、H、OH、OCOR'、OCOOR'、OCONHR'、OR'、OSO<sub>2</sub>-、  
OP(OH)<sub>2</sub>-（但し、R'は、線状または分枝鎖状のアルキル基；ヒドロキシア  
ルキル基；アミノアルキル基を表わす）を表わすか；  
またはフェニル基またはピリジル基（但し、これらの双方は、アルキル基、アル  
コキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''  
は、水素原子を表わすかあるいは線状または分枝鎖状のアルキル基を表わす）  
からなる群から独立に選択されていてもよい3個までの置換基によって置換され  
ていてもよい）を表わすか；またはフェニルアルキル基（但し、アルキル成分は  
、ヒドロキシ基またはアミノ基によって置換されていてもよく、かつフェニル基  
は、独立に線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、ハロゲン原子、ニトロ、  
CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''は上記と同様に定義されている）か  
らなる群から選択されていてもよい3個までの置換基に

よって置換されていてもよい）を表わし；

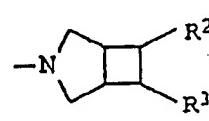
Zは、アミノヘテロ環を表わし：



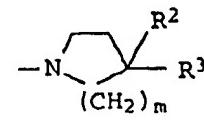
Z-1



Z-2



Z-3



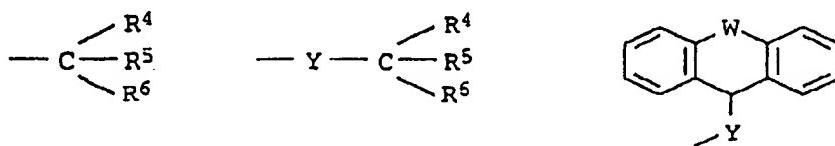
Z-4

〔式中、

mは、2または3であり、

R' および R'' は、互いに独立に水素原子（但し、R' および R'' は同時に水素原子ではない）、シクロアルキル基を表わすか；または環が、線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ、ハロゲン原子、ニトロ、C F<sub>3</sub>、N R' R''（但し、R' および R'' は上記と同様に定義されている）からなる群から選択されている 3 個までの置換基によって置換されていてもよいフェニル基またはフェニルアルキル基、またはピリジル基を表わし；

または残りは：



〔式中、

R' は、水素原子、ヒドロキシ基またはシクロアルキル基を表わし；

R'' は、水素原子またはシクロアルキル基を表わし、

かつ R' は、シクロアルキル基を表わすか；

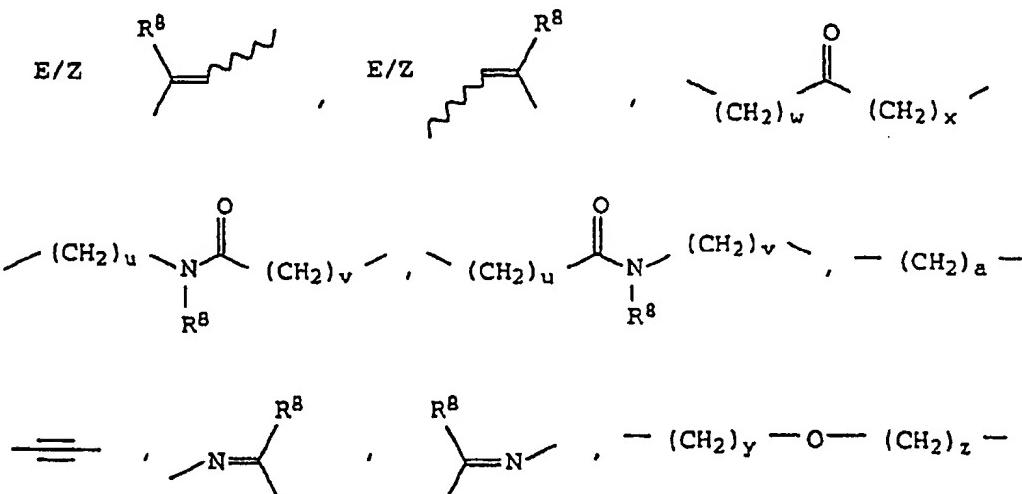
または R'、R'' および R''' は、フェニル基またはフェニルアルキル基またはピリジル基の群から独立に選択されており、この場合、これらの全ての基は、線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ、ハロゲン原子、ニトロ、C F<sub>3</sub>、N R' R''（但し、R' および R'' は上記と同様に定義されている）からなる群から独立に選択されていてもよい 3 個までの置換基によって置換されていてもよく；

Y は、カルボニル成分を表わすかまたは n が 0、1、2 または 3 である (C H<sub>n</sub>)<sub>o</sub> 成分を表わし、

W は、酸素原子、硫黄原子を表わすかまたは式：N R''（但し、R'' は、水素原子あるいは線状または分枝鎖状のアルキル基であってもよい）で示される基、カルボニル成分または以下の成分：-O-(C H<sub>n</sub>)<sub>o</sub>-、-C H=C H-、-(C H<sub>n</sub>)<sub>o</sub>-、-N H-C H<sub>n</sub>-、-N=C H-、-(C=O)-N R''（但し、q は、0、1 または 2 であり、p は、0、1 または 2 である）のいずれか 1 つを表

わし；

Aは、構造式：



(式中、R'は、水素原子、線状または分枝鎖状のアルキル基、アリル基、アルコキシ基、ベンジル基またはCF<sub>3</sub>を表わす)を表わし；

aは、1、2、3または4であり、uおよびvは、0、1または2であり（但し、uとvとの総和は、3を上廻らない）、wおよびxは、0、1または2であり（但し、wとxとの総和は、3を上廻らない）、yおよびzは、互いに独立に0、1または2であり、

Bは、以下の基：

フェニル基（但し、Aが-O-CH<sub>2</sub>-である場合には、Bは、フェニル基ではない）、ピリジル基、ピリミジル基、ピリダジニル基、ピラジニル基、ナフチル基、キノリニル基、イソキノリニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、シンノリニル基、インダニル基、ベンゾフラニル基、ベンズイソチアゾリル基、ナフチリジニル基またはシクロペンタジエニル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、CF<sub>3</sub>、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、NR'R''（但し、R'およびR''は、上記と同様に定義さ

れている）、アルキル-NR'R''（但し、R'およびR''は、上記と同様に定

義されている) からなる群から選択された 3 個までの置換基によって置換されていてもよく;

または 1, 3, 5-トリアジニル基、フラニル基、チエニル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基またはイソチアゾリル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、C F<sub>3</sub>、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、N R' R'' (但し、R' および R'' は、上記と同様に定義されている)、アルキル-N R' R'' (但し、R' および R'' は、上記と同様に定義されている) からなる群から選択された 2 個までの置換基によって置換されていてもよく;

またはインドリル基、ベンズイミダゾリル基、ピロリル基、イミダゾリル基またはピラゾリル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、C F<sub>3</sub>、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、N R' R'' またはアルキル-N R' R'' (但し、R' および R'' は、上記と同様に定義されている) からなる群から選択された 3 個までの置換基によって炭素が置換されていてもよく、かつ線状または分枝鎖状のアルキル基、フェ

ニルアルキル基、アシリアルキル基、フェニルアシリアルキル基またはフェニルアシリル基からなる群から選択された置換基によって窒素原子が置換されていてもよく;

または 1, 2, 3-トリアゾリル基または 1, 2, 4-トリアゾリル基、この場合、これらの基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、C F<sub>3</sub>、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、N R' R'' またはアルキル-N R' R'' (但し、R' および R'' は、上記と同様に定義されている)、フェニル基、ベンジル基 (但し、この 2 個の残基は、ハロゲン原子、アルキル、アルコキシ、C F<sub>3</sub> から選択された 2 個までの置換基によって独立に置換されていてもよい) からなる群から選択された置換基によって炭素原子が置換されていてもよく、かつ

線状または分枝鎖状のアルキル基、フェニルアルキル基、アシリアルキル基、フェニルアシリアルキル基またはフェニルアシリル基からなる群から選択された置換基によって窒素原子が置換されていてもよく；

または 1, 2, 3-オキサジアゾリル基、1, 2, 4-オキサジアゾリル基、1, 3, 5-オキサジアゾリル基、1, 2, 5-オキサジアゾリル基、1, 2, 3-チアジアゾリル基、1, 2, 4-チアジアゾリル基、1, 2, 5-チアジアゾリル基または 1, 3, 5-チ

アジアゾリル基、この場合、これらの基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、CF<sub>3</sub>、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、NR'R"またはアルキル-NR'R"（但し、R'およびR"は、上記と同様に定義されている）、フェニル基、ベンジル基（但し、この2個の残基は、ハロゲン原子、アルキル、アルコキシ、CF<sub>3</sub>から選択された2個までの置換基によって独立に置換されていてもよい）からなる群から選択された置換基によって置換されていてもよく；

または 1, 2, 3, 4-オキサトリアゾリル基または 1, 2, 3, 5-オキサトリアゾリルから選択された環系を表わし；

R および R' は、それぞれ、水素原子、ヒドロキシ基、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、CF<sub>3</sub>、NR'R"（但し、R' および R" は、上記と同様に定義されている）から独立に選択された置換基を表わすかあるいは式1のフェニル成分に環付加され、従って、ナフタレン、テトラヒドロナフタレン、テトラメチルテトラヒドロナフタレン、インデン、インドール、ベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ベンズイミダゾールからなる群から選択された二環式環を形成し、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、ニトロ基、CF<sub>3</sub>、ハロ

ゲン原子、ニトロ基、NR'R"（但し、R' および R" は、上記と同様に定義されている）からなる群から独立に選択された3個までの置換基によって炭素原

子が場合によっては置換されている炭素環またはヘテロ環を表わす]で示される新規の1-アミノ-3-フェノキシープロパン誘導体。

2 抗癌剤の薬効増強のための医薬調剤において、該医薬調剤が、請求項1に記載の式1の化合物または該化合物の製薬学的に認容性の塩と製薬学的に認容性の担持剤または稀釀剤からなることを特徴とする、抗癌剤の薬効増強のための医薬調剤。

3 化学療法剤の作用量および化学療法剤の抗腫瘍作用を増強する化合物の作用量からなる抗腫瘍用組成物において、増強剤が請求項1の化合物から選択されていることを特徴とする、抗腫瘍用組成物。

4) 癌によって苦しむ患者の癌を治療するための方法において、前記の患者に抗癌剤および式1の化合物を投与することを特徴とする癌の治療法。

## 【発明の詳細な説明】

マルチ・ドラッグ耐性のモジュレーターとしての1-アミノ-3-フェノキシ-プロパン誘導体

化学療法剤に抗する耐性の発生は、臨床的な癌治療の場合の度重なる過ちに主たる原因がある。癌細胞の型に応じて、種々の分子メカニズムは、化学療法剤を無力にしてしまう。

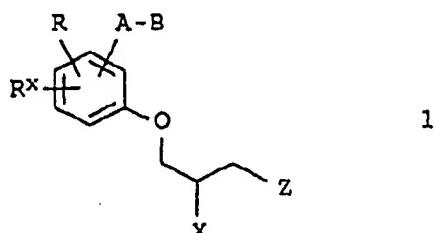
マルチ・ドラッグ耐性 (Multi-Drug-Resistant) (以下、MDRと省略される) 表現型 (S. Kuzmich他、Med. Res. Rev. 1991年、第11巻、第185頁) という語は、単独の細胞毒性剤に対する耐性のために使用されてはいるが、しかし、構造的にも機能的にも関係のない種々の化合物が相互耐性を示すことが見出されているような表現型のために作り出されたものである。このMDR表現型は、ビニカ・アルカロイド、アントラシクリンおよびエピボドフィロトキシンを用いる処理について観察される。プラスの相互関係は、170Kダルトンの分子量のMDRI-遺伝子生成物 p-糖蛋白質 (以下、p170と省略される) と、MDRの出現との間に存在する (J. Bell他、Cancer Invest. 1991年、第9巻、第563頁)。p170は、ATPによりエネルギー供給された流出ポン

プとして作用し、このポンプは、細胞毒性化合物を内部細胞質からむしろ非特異的方法で排出する。この数年、異なる種類の化合物が、MDRを変化させることができた。この種の化合物は：ベラパミル (verapamil) (E. Pommerenke他、Arzneim.-Forsch. 1991年、第41巻 (II) 、第855頁)、ニグルジピン (niguldipine) (A. Reymann他、Arch. Pharmacol. 1991年、343、Suppl. R50)、シクロスボリン (cyclosporine) A およびキニーネ (quinine) (E. Solary他、Cancer 1991年、第68巻、第1714頁) である。前記化合物の全ては、MDR変性以外の臨床的な使用のために開発されたので、深刻な副作用を有している（例えば、血圧降下または免疫系の抑制）。このことは、慣用の癌治療の場合に、MDRモジュレーターとしての化合物を使用することを困難なものにしてしまう。従って、副作用または毒性を低減した新規のモジュレーターが必要とされる。

本発明は、ビンクリスチン、ビンブラスチン、アドリアマイシンおよびエトボ

サイドのような化学療法剤に抗する腫瘍細胞の耐性を変性するのに効力がある1-アミノ-3-フェノキシープロパン-誘導体の調製および使用を記載するものである。

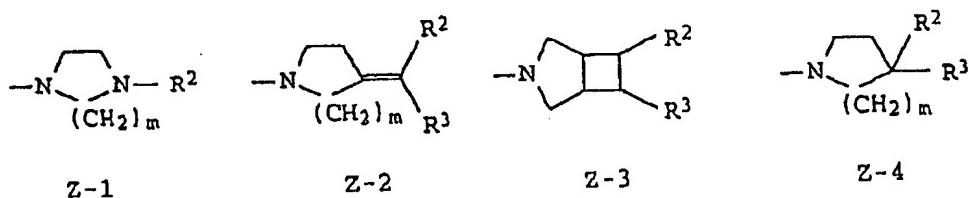
本発明は、式1：



(式中、

Xは、H、OH、OCOR'、OCOOR'、OCONHR'、OR'、OSO<sub>2</sub>-、OP(OH)<sub>2</sub>-（但し、R'は、線状または分枝鎖状のアルキル基；ヒドロキシアルキル基；アミノアルキル基を表わす）を表わすか；またはフェニル基またはピリジル基（但し、これらの双方は、アルキル基、アルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''は、水素原子を表わすかあるいは線状または分枝鎖状のアルキル基を表わす）からなる群から独立に選択されていてもよい3個までの置換基によって置換されていてもよい）を表わすか；またはフェニルアルキル基（但し、アルキル成分は、ヒドロキシ基またはアミノ基によって置換されていてもよく、かつフェニル基は、独立に線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、ハロゲン原子、ニトロ、CF<sub>3</sub>、NR'R''（但し、R'およびR''は上記と同様に定義されている）からなる群から選択されていてもよい3個までの置換基によって置換されていてもよい）を表わし；

Zは、アミノヘテロ環を表わし：

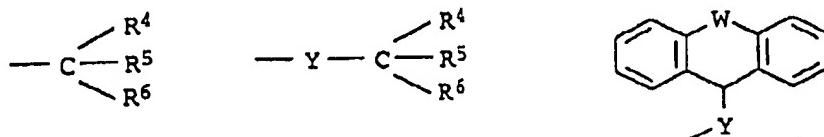


(式中、

mは、2または3であり、

$R'$  および  $R''$  は、互いに独立に水素原子（但し、 $R'$  および  $R''$  は同時に水素原子ではない）、シクロアルキル基を表わすか；または環が、線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ、ハロゲン原子、ニトロ、 $C_F_3$ 、 $NR'R''$ （但し、 $R'$  および  $R''$  は上記と同様に定義されている）からなる群から選択されている 3 個までの置換基によって置換されていてもよいフェニル基またはフェニルアルキル基、またはピリジル基を表わし；

または残りは：



〔式中、

$R'$  は、水素原子、ヒドロキシ基またはシクロアルキル基を表わし；

$R''$  は、水素原子またはシクロアルキル基を表わし、かつ  $R'$  は、シクロアルキル基を表わすか；

または  $R'$ 、 $R''$  および  $R'''$  は、フェニル基またはフェニルアルキル基またはピリジル基の群から独立に選択されており、この場合、これらの全ての基は、線状または分枝鎖状アルキル、アルコキシ、アルキレンジオキシ、ハロゲン原子、ニトロ、 $C_F_3$ 、 $NR'R''$ （

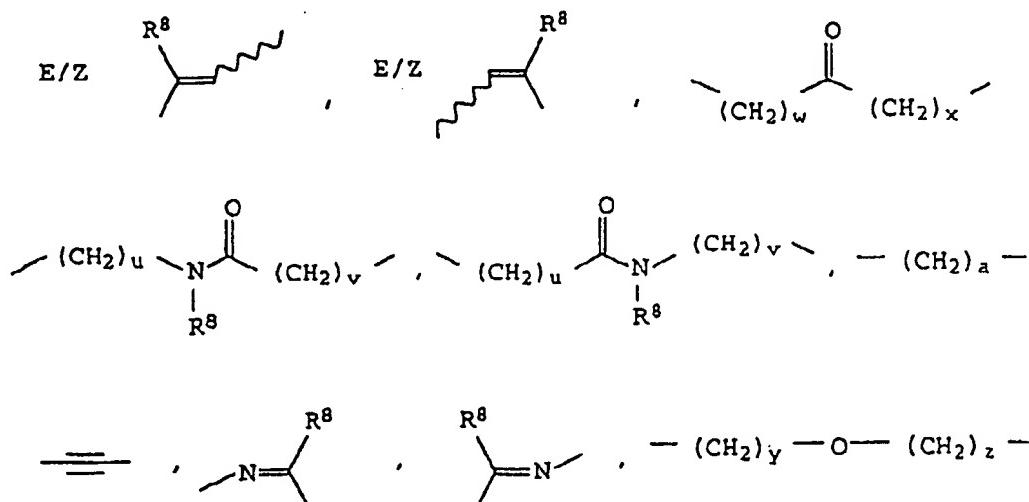
但し、 $R'$  および  $R''$  は上記と同様に定義されている）からなる群から独立に選択されていてもよい 3 個までの置換基によって置換されていてもよく；

$Y$  は、カルボニル成分を表わすかまたは  $n$  が 0、1、2 または 3 である ( $C_H_n$ )<sub>n</sub>-成分を表わし、

$W$  は、酸素原子、硫黄原子を表わすかまたは式： $NR''$ （但し、 $R''$  は、水素原子あるいは線状または分枝鎖状のアルキル基であってもよい）で示される基、カルボニル成分または以下の成分： $-O-(C_H_2)_n-$ 、 $-CH=CH-$ 、 $-(C_H_2)_n-$ 、 $-NH-CH_2-$ 、 $-N=CH-$ 、 $-(C=O)-NR''$ （但し、 $q$  は、0、1 または 2 であり、 $p$  は、0、1 または 2 である）のいずれか 1 つを表

わし；

A は、構造式：



(式中、R'は、水素原子、線状または分枝鎖状のアルキル基、アリル基、アルコキシ基、ベンジル基また

はC F<sub>3</sub>を表わす)を表わし；

aは、1、2、3または4であり、uおよびvは、0、1または2であり（但し、uとvとの総和は、3を上廻らない）、wおよびxは、0、1または2であり（但し、wとxとの総和は、3を上廻らない）、yおよびzは、互いに独立に0、1または2であり、

Bは、以下の基：

フェニル基（但し、Aが-O-CH<sub>2</sub>-である場合には、Bは、フェニル基ではない）、ピリジル基、ピリミジル基、ピリダジニル基、ピラジニル基、ナフチル基、キノリニル基、イソキノリニル基、キノキサリニル基、キナゾリニル基、シンノリニル基、インダニル基、ベンゾフラニル基、ベンズイソチアゾリル基、ナフチリジニル基またはシクロペンタジエニル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、C F<sub>3</sub>、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、N R' R''（但し、R'およびR''は、上記と同様に定義されている）、アルキル-N R' R''（但し、R'およびR''は、上記と同様に定義されている）。

定義されている) からなる群から選択された 3 個までの置換基によって置換され  
ていてもよく;

または 1, 3, 5-トリアジニル基、フラニル基、チエニル基、オキサゾリル基  
、イソオキサゾリル基、チア

ゾリル基またはイソチアゾリル基、この場合、これら全ての基は、線状または分  
枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキ  
シアルキル基、カルボニルアルコキシ基、C F<sub>3</sub>、ハロゲン原子、シアノ基、ニ  
トロ基、N R' R" (但し、R' および R" は、上記と同様に定義されている)  
、アルキル-N R' R" (但し、R' および R" は、上記と同様に定義されてい  
る) からなる群から選択された 2 個までの置換基によって置換されていてもよく  
;

またはインドリル基、ベンズイミダゾリル基、ピロリル基、イミダゾリル基または  
ピラゾリル基、この場合、これら全ての基は、線状または分枝鎖状のアルキル  
基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カ  
ルボニルアルコキシ基、C F<sub>3</sub>、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、N R' R  
" またはアルキル-N R' R" (但し、R' および R" は、上記と同様に定義さ  
れている) からなる群から選択された 3 個までの置換基によって炭素が置換され  
ていてもよく、かつ線状または分枝鎖状のアルキル基、フェニルアルキル基、ア  
シリアルキル基、フェニルアシリアルキル基またはフェニルアシル基からなる群  
から選択された置換基によって窒素原子が置換されていてもよく;

または 1, 2, 3-トリアゾリル基または 1, 2, 4-トリアゾリル基、この場  
合、これらの基は、線状ま

たは分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロ  
メトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、C F<sub>3</sub>、ハロゲン原子、シアノ  
基、ニトロ基、N R' R" またはアルキル-N R' R" (但し、R' および R"  
は、上記と同様に定義されている) 、フェニル基、ベンジル基 (但し、この 2 個  
の残基は、ハロゲン原子、アルキル、アルコキシ、C F<sub>3</sub> から選択された 2 個ま

での置換基によって独立に置換されていてもよい) からなる群から選択された置換基によって炭素原子が置換されていてもよく、かつ線状または分枝鎖状のアルキル基、フェニルアルキル基、アシルアルキル基、フェニルアシルアルキル基またはフェニルアシル基からなる群から選択された置換基によって窒素原子が置換されていてもよく;

または 1, 2, 3-オキサジアゾリル基、1, 2, 4-オキサジアゾリル基、1, 3, 5-オキサジアゾリル基、1, 2, 5-オキサジアゾリル基、1, 2, 3-チアジアゾリル基、1, 2, 4-チアジアゾリル基、1, 2, 5-チアジアゾリル基または 1, 3, 5-チアジアゾリル基、この場合、これらの基は、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、メトキシアルキル基、トリフルオロメトキシアルキル基、カルボニルアルコキシ基、CF<sub>3</sub>、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、NR'R" またはアルキル-NR'R" (但し、R' および R" は、上記と同様に定義され

ている)、フェニル基、ベンジル基(但し、この 2 個の残基は、ハロゲン原子、アルキル、アルコキシ、CF<sub>3</sub> から選択された 2 個までの置換基によって独立に置換されていてもよい) からなる群から選択された置換基によって置換されていてもよく;

または 1, 2, 3, 4-オキサトリアゾリル基または 1, 2, 3, 5-オキサトリアゾリルから選択された環系を表わし;

R および R' は、それぞれ、水素原子、ヒドロキシ基、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、ハロゲン原子、ニトロ基、CF<sub>3</sub>、NR'R" (但し、R' および R" は、上記と同様に定義されている) から独立に選択された置換基を表わすかあるいは式 1 のフェニル成分に環付加され、従って、ナフタレン、テトラヒドロナフタレン、テトラメチルテトラヒドロナフタレン、インデン、インドール、ベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ベンズイミダゾールからなる群から選択された二環式環を形成し、線状または分枝鎖状のアルキル基、アルコキシ基、ニトロ基、CF<sub>3</sub>、ハロゲン原子、ニトロ基、NR'R" (但し、R' および R" は、上記と同様に定義されている) からなる群から独立に選択された 3 個

までの置換基によって炭素原子が場合によっては置換されている炭素環またはヘテロ環を表わす)で示される新規の1-アミノ-3-フェノキシープロパン誘導体を提供する。

式1の化合物は、種々の立体中心を有していてもよく、全ての可能な異性体の混合物を含める前記化合物の全ての可能な立体異性体および位置異性体は、請求項1により包含されていることが理解される。1個またはそれ以上の立体中心を有する式1の化合物のエナンチオマー的に純粋な物質は、以下の方法:エナンチオマー的に純粋な出発物質の使用、光学活性の酸を用いて形成されたジアステレオ異性体の塩の分別結晶化、キラル固定相を用いるクロマトグラフィーによる分離によって得ることができる。

式1の1-アミノ-3-フェノキシープロパン誘導体は、遊離塩基または該遊離塩基の製薬学的に適当な塩として使用することができる。塩の形成のための有利な酸は、塩酸、臭化水素酸、硫酸、燐酸、メタンスルホン酸、4-トルエンスルホン酸、フマル酸、リンゴ酸、蘚酸、マロン酸、クエン酸、酒石酸、プロピオン酸、酢酸、蟻酸、安息香酸または(例えば、J. Pharm. Sci.、第66巻、第1号、第1~17頁(1977年)に記載されているような)他の生理学的に認容性の酸である。

本願明細書で使用されているものとしては、上記の用語は、以下の有利な意味を有する:

ハロゲン原子は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子を表わし;アルキル基は、メチル基、エチル基、プロピル基またはブチル基もしくは前記の基の位置的異性体を表わし;

N R' R" は、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、第三ブチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルエチルアミノ基、ジブロピルアミノ基、ジイソブロピルアミノ基を表わし;

アルコキシ基は、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、ブトキシ基または前

記の基の位置的異性体を表わし；

ヒドロキシアルキル基は、2-ヒドロキシエチル基、2-ヒドロキシプロピル基、2-ヒドロキシブチル基を表わし；

アミノアルキル基は、1-アミノメチル基、1-アミノエチル基、1-アミノメチルプロピル基を表わし；

フェニルアルキル基は、フェニルメチル基、2-(フェニル)-エチル基、3-(フェニル)-ブロピル基または前記の基の位置的異性体を表わし、この場合、附加的に、線状または分枝鎖状のアルキル基(有利にC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)、ヒドロキシ基、アルコキシ基(有利にC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>)、ハロゲン原子、ニトロ基、CF<sub>3</sub>、NR'、R''(但し、R'およびR''は、上記と同様に定義されている)からなる群から独立に選択されていてもよい3個までの置換基によって置換されていてもよく；アルキレンジオキシ基は、メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基を表わし；Zは、ビペラジン、ホモビペラジン、ピペリジン、ホ

モビペリジンのような置換アミノヘテロ環を表わすかまたは6位および/または7位で置換されたエキソ-3-アザビシクロ-[3.2.0]-ヘプタンのような環付加された二環式基を表わす。

Zの成分であるR'およびR''の例は、以下の基：

水素原子(但し、R'およびR''は、同時に水素原子ではない)；

フェニル基、4-フルオロフェニル基、4-クロロフェニル基、4-第三ブチルフェニル基、4-メトキシフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、3-フルオロフェニル基、3-クロロフェニル基、3-第三ブチルフェニル基、3-メトキシフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、2-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、2-第三ブチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、2,3,4-トリメトキシフェニル基、3,4-メチレンジオキシフェニルメチル基、(4-フルオロフェニル)-メチル基、(4-クロロフェニル)-メチル基、(4-

第三ブチルフェニル) -メチル基、(4-メトキシフェニル) -メチル基、(4-トリフルオロメチルフェニル) -メチル基、(4-ジメチルアミノフェニル)

-

メチル基、(3-フルオロフェニル) -メチル基、(3-クロロフェニル) -メチル基、(3-第三ブチルフェニル) -メチル基、(3-メトキシフェニル) -メチル基、(3-トリフルオロメチルフェニル) -メチル基、(3-ジメチルアミノフェニル) -メチル基、(2-フルオロフェニル) -メチル基、(2-クロロフェニル) -メチル基、(2-第三ブチルフェニル) -メチル基、(2-メトキシフェニル) -メチル基、(2-トリフルオロメチルフェニル) -メチル基、(2-ジメチルアミノフェニル) -メチル基、(3, 4-ジメトキシフェニル) -メチル基、(2, 3, 4-トリメトキシフェニル) -メチル基、(3, 4, 5-トリメトキシフェニル) -メチル基、(3; 4-メチレンジオキシフェニル) -メチルフェニルエチル基、(4-フルオロフェニル) -エチル基、(4-クロロフェニル) -エチル基、(4-第三ブチルフェニル) -エチル基、(4-メトキシフェニル) -エチル基、(4-トリフルオロエチルフェニル) -エチル基、(4-ジメチルアミノフェニル) -エチル基、(3-フルオロフェニル) -エチル基、(3-クロロフェニル) -エチル基、(3-第三ブチルフェニル) -エチル基、(3-メトキシフェニル) -エチル基、(3-トリフルオロメチルフェニル) -エチル基、(3-ジメチルアミノフェニル) -エチル基、(2-フルオロフェニル) -エチル基、(2-クロロフェニル) -エチル基、

エチル基、(2-第三ブチルフェニル) -エチル基、(2-メトキシフェニル) -エチル基、(2-トリフルオロメチルフェニル) -エチル基、(2-ジメチルアミノフェニル) -エチル基、(3, 4-ジメトキシフェニル) -エチル基、(2, 3, 4-トリメトキシフェニル) -エチル基、(3, 4-メチレンジオキシフェニル) -エチル基、(3, 4-ジメトキシフェニル) -エチル基、(2, 3, 4-トリメトキシフェニル) -エチル基、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、(2-ピ

リジル) -メチル基、(3-ピリジル) -メチル基、(4-ピリジル) -メチル基、(2-ピリジル) -エチル基、(3-ピリジル) -エチル基、(4-ピリジル) -エチル基、ジフェニルメチル基、ビス(4-フルオロフェニル) -メチル基、ビス(4-クロロフェニル) -メチル基、ビス(4-第三ブチルフェニル) -メチル基、ビス(4-メトキシフェニル) -メチル基、ビス(4-トリフルオロメチルフェニル) -メチル基、ビス(4-ジメチルアミノフェニル) -メチル基、ビス(3, 4-ジメトキシフェニル) -メチル基、ビス(2, 3, 4-トリメトキシフェニル) -メチル基、ビス(2-ピリジル) -メチル基、ビス(3-ピリジル) -メチル基、ビス(4-ピリジル) -メチル基、2, 2-ジフ

ェニルエチル基、2, 2-ビス(4-フルオロフェニル) -エチル基、2, 2-ビス(4-クロロフェニル) -エチル基、2, 2-ビス(4-第三ブチルフェニル) -エチル基、2, 2-ビス(4-メトキシフェニル) -エチル基、2, 2-ビス(4-トリフルオロメチルフェニル) -エチル基、2, 2-ビス(4-ジメチルアミノフェニル) -エチル基、2, 2-ビス(3, 4-ジメトキシフェニル) -エチル基、2, 2-ビス(2, 3, 4-トリメトキシフェニル) -エチル基、2, 2-ビス(3, 4, 5-トリメトキシフェニル) -エチル基、2, 2-ビス(2-ピリジル) -エチル基、2, 2-ビス(3-ピリジル) -エチル基、2, 2-ビス(4-ピリジル) -エチル基、トリフェニルメチル基、フェニル-(2-ピリジル) -メチル基、フェニル-(3-ピリジル) -メチル基、フェニル-(4-ピリジル) -メチル基、2-フェニル-2-(2-ピリジル) -エチル基、2-フェニル-2-(4-ピリジル) -エチル基、シクロヘキシリ-フェニル-メチル基、2-シクロヘキシリ-2-フェニル-エチル基、シクロヘキシリ-(2-ピリジル) -メチル基、シクロヘキシリ-(3-ピリジル) -メチル基、シクロヘキシリ-(4-ピリジル) -メチル基、2-(シクロヘキシリ)-2-(2-ピリジル) -エチル基、2-シクロヘキシリ-2-(3-ピリジル)

-エチル基、2-シクロヘキシル-2-(4-ピリジル)-エチル基、3,3-ジフェニルプロピル、3,3,3-トリフェニルプロピル基、フェニルアセチル基、2-(4-フルオロフェニル)-アセチル基、2-(4-クロロフェニル)-アセチル基、2-(4-第三ブチルフェニル)-アセチル基、2-(4-メトキシフェニル)-アセチル基、2-(4-トリフルオロアセチルフェニル)-アセチル基、2-(4-ジメチルアミノフェニル)-アセチル基、2-(3,4-ジメトキシフェニル)-アセチル基、2-(2,3,4-トリメトキシフェニル)-アセチル基、2-(2-ピリジル)-アセチル基、2-(3-ピリジル)-アセチル基、2-(4-ピリジル)-アセチル基、2,2-ジフェニルアセチル基、2,2-トリフェニルアセチル基、2,2-ビス(4-フルオロフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(4-クロロフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(4-第三ブチルフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(4-メトキシフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(4-トリフルオロエチルフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(4-ジメチルアミノフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(2,3,4-トリメトキシフェニル)-アセチル基、2,2-ビス(2-ピリジル)-アセチル基、2,2-ビス(3-ピリジル)-アセチル基、2,

2-ビス(4-ピリジル)-アセチル基、2-フェニル-2-(2-ピリジル)-アセチル基、2-フェニル-2-(3-ピリジル)-アセチル基、2-フェニル-2-(4-ピリジル)-アセチル基、2-シクロヘキシル-2-フェニル-アセチル基、2-シクロヘキシル-2-(2-ピリジル)-アセチル基、2-シクロヘキシル-2-(3-ピリジル)-アセチル基、2-シクロヘキシル-2-(4-ピリジル)-アセチル基、5-フルオレニル基、5-ジベンゾスペラニル基、5-ジベンゾスペレニル基、5-ジベンゾスペラニリデン基、5-ジベンゾスペレニリデン基、9,10-ジヒドロアントラセニル基、9-キサンテニル基、9-チオキサンテニル基、6,11-ジヒドロベンズ[b,e]オキセピニ-11-イル基、ジベンゾ-[b,f]アゼピニ-5-イル基、10,11-ジヒドロジベンゾ-[b,f]アゼピニ-5-イル基、フルオレン-5-カルボニル基

、ジベンゾスペロン-5-カルボニル基、ジベンゾスペレン-5-カルボニル基、9,10-ジヒドロアントラセン-カルボニル基、キサンテン-9-カルボニル基、9-チオキサンテンカルボニル基、6,11-ジヒドロベンズ [b, e] オキセピン-11-カルボニル基、ジベンゾ [b, f] アゼピン-5-カルボニル基、10,11-ジヒドロベンゾ [b, f] アゼピン-5-カルボニル基を包含する。

Aは、以下の基の1つを表す：

(E)-ビニレン、(Z)-ビニレン、(E)-1-メチル-ビニレン、(E)-1-エチル-ビニレン、(E)-1-プロピル-ビニレン、(E)-1-ブチル-ビニレン、(E)-1-イソ-プロピル-ビニレン、(E)-1-第三ブチル-ビニレン、(Z)-1-メチル-ビニレン、(Z)-1-エチル-ビニレン、(Z)-1-ブチル-ビニレン、(Z)-1-イソブチル-ビニレン、(Z)-1-第三ブチル-ビニレン、(E)-2-メチル-ビニレン、(E)-2-エチル-ビニレン、(E)-2-ブチル-ビニレン、(E)-2-ブチル-エチニル、(E)-2-イソブチル-ビニレン、(E)-2-第三ブチル-ビニレン、(Z)-2-メチル-ビニレン、(Z)-2-エチル-ビニレン、(Z)-2-ブチル-ビニレン、(Z)-2-イソブチル-ビニレン、(Z)-2-第三ブチル-ビニレン、(E)-1-トリフルオロメチル-ビニレン、(Z)-1-トリフルオロメチル-ビニレン；

(E)-1-メトキシ-ビニレン、(E)-1-エトキシ-ビニレン、(E)-1-ブロボキシ-ビニレン、(E)-1-ブトキシ-ビニレン、(E)-1-イソブロボキシ-ビニレン、(E)-1-第三ブトキシ-ビニレン、(E)-2-メトキシ-ビニレン、(E)

-2-エトキシ-ビニレン、(E)-2-ブロボキシ-ビニレン、(E)-2-ブトキシ-ビニレン、(E)-2-イソブロボキシ-ビニレン、(E)-2-第三ブトキシ-ビニレン、(Z)-1-メトキシ-ビニレン、(Z)-1-エトキ

シーピニレン、(Z)-1-プロポキシーピニレン、(Z)-1-ブトキシーピニレン、(Z)-1-イソプロポキシーピニレン、(Z)-1-第三ブトキシーピニレン、(Z)-2-メトキシーピニレン、(Z)-2-エトキシーピニレン、(Z)-2-ブロボキシーピニレン、(Z)-2-ブトキシーピニレン、(Z)-2-イソプロボキシーピニレン、(Z)-2-第三ブトキシーピニレン；エチニレン；

メチレン、ジメチレン、トリメチレン、テトラメチレン；

カルボニル、カルボニルメチレン、メチレンカルボニル、カルボニルジメチレン、メチレンカルボニルメチレン、ジメチレンカルボニル、カルボニルトリメチレン、トリメチレンカルボニル、メチレンカルボニルジメチル、ジメチレンカルボニルメチレン；

オキシ、オキシメチレン、オキシジメチレン、メチレンオキシ、ジメチレンオキシ、メチレンオキシメチレン、メチレンオキシジメチレン、ジメチレンオキシメチレン、ジメチレンオキシジメチレン；

カルボニルイミノ、メチレンカルボニルイミノ、N-

メチルーカルボニルイミノ、N-メチルーアメチレンカルボニルイミノ、イミノカルボニル、イミノカルボニルメチレン、N-メチル-イミノカルボニル、N-メチル-イミノメチレンカルボニル、N-ジメチレンカルボニルイミノ、N-エチル-ジメチレンカルボニルイミノ、N-エチル-イミノカルボニル、N-エチル-イミノジメチレン、N-ブロピル-カルボニルイミノ、N-ブロピル-ジメチレンカルボニル、N-ブロピル-イミノカルボニル、N-ブロピル-イミノメチレンカルボニル、N-イソブロピル-カルボニルイミノ、N-イソブロピル-メチレンカルボニルイミノ、N-イソブロピル-イミノカルボニル、N-イソブロピル-イミノメチレンカルボニル、カルボニルイミノメチレン、カルボニル-N-メチル-イミノメチレン、カルボニル-N-エチル-イミノメチレン、カルボニル-N-イソブロピル-イミノメチレン、ジメチレンカルボニル-N-メチル-イミノメチレン、ジメチレンカルボニル-N-エチル-イミノメチレン

、ジメチレンカルボニル-N-プロピル-イミノメチレン、ジメチレンカルボニル-N-イソプロピル-イミノメチル；

メチリデンアザ、アザメチリデン、メチレンメチリデンアザ、ジメチレンメチリデンアザ、トリメチレンメチリデンアザ、(メチル)-メチリデンアザ、(イソ

プロピル)-メチリデンアザ、(第三ブチル)-メチリデンアザ、(トリフルオロメチル)-メチリデンアザ、アザメチリデンメチレン、アザメチリデンジメチレン、アザメチリデントリメチレン、アザ-(メチル)-メチリデン、アザ-(第三ブチル)-メチリデン、アザ-(トリフルオロメチル)-メチリデン、(メトキシ)-メチリデンアザ、(エトキシ)-メチリデンアザ、(プロボキシ)-メチリデンアザ、(ブトキシ)-メチリデンアザ、(イソブロボキシ)-メチリデンアザ、(第三ブトキシ)-メチリデンアザ、アザ-(メトキシ)-メチリデン、アザ-(エトキシ)-メチリデン、アザ-(プロボキシ)-メチリデン、アザ-(ブトキシ)-メチリデン、アザ-(イソブロボキシ)-メチリデン、アザ-(第三ブトキシ)-メチリデン；

シクロプロピレン、3-メチル-シクロプロピレン、3,3-ジメチル-シクロプロピレン、3-エチル-シクロプロピレン、3-ブロピル-シクロプロピレン、3-ブチルシクロプロピレン、3-イソブロピル-シクロプロピレン、3-第三ブチル-シクロプロピレン、3-フルオロ-シクロプロピレン、3-グロロ-シクロプロピレン、オキシラニレン。

Xは、以下の基の1つを表す：

水素原子、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、プロボキシ、ブトキシ、イソブロボキシ、第三ブトキシ、フ

エノキシ、ベンジルオキシ、フェネトキシ、ホルミルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、2-ヒドロキシ-ブロピオニルオキシ、2-アミノ-アセチルオキシ、2-アミノ-ブロピオニルオキシ、2-アミノ-3-メチル-ブロピオニルオキシ、ベンゾイルオキシ、2-ピリドイル、3-ピリドイル、4-ピリドイル、2-フェニル-アセチルオキシ、2-フェニル-アセチルオキシ、2

-ヒドロキシ-2-フェニルアセチルオキシ；

メチルアミノカルボニルオキシ、フェニルアミノカルボニルオキシ。

R および R' は、それぞれ、以下の基から独立に選択することができる 2 個までの基を表す：

メチル、エチル、n-プロピル、ブチル、イソプロピル、第三ブチル、トリフルオロメチルメトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ、イソプロポキシ、第三ブトキシ、フルオロ、クロロ、プロモ、ニトロ、アミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、第三ブチルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、メチルエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ；

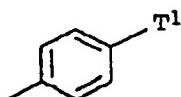
または R および R' は、この R および R' を結合しているフェニル基と一緒にになって、以下の群：

ナフタレン、テトラヒドロナフタレン、テトラメチルテトラヒドロナフタレン、インデン、インドール、ベ

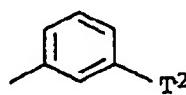
ンソフラン、ベンゾチオフェン、ベンズイミダゾールから選択された二環式環系を形成する。

B の例は、以下のような構造を包含する：

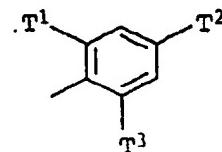
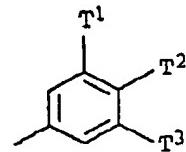
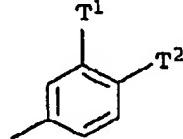
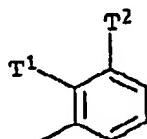
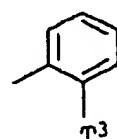
$T^1 =$  H, F, Cl, Br, I, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, OH, OCH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, COOCH<sub>3</sub>, COOCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,



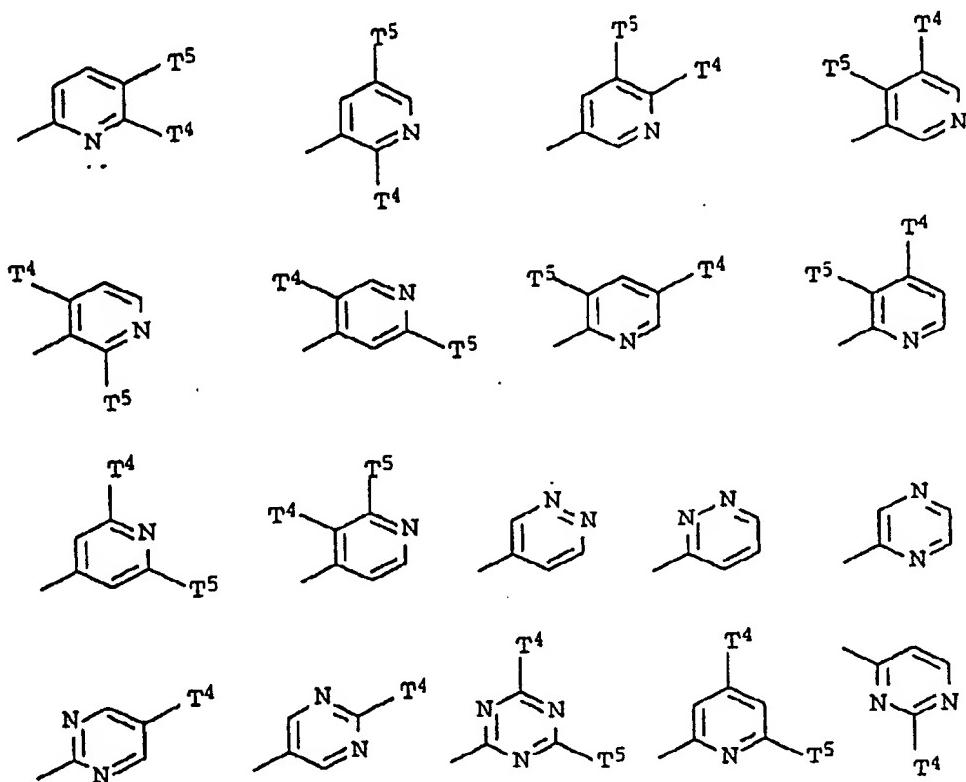
$T^2 =$  H, F, Cl, Br, I, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, OH, OCH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, COOCH<sub>3</sub>, COOCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,



$T^3 =$  H, F, Cl, Br, I, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, OH, OCH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, COOCH<sub>3</sub>, COOCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>,

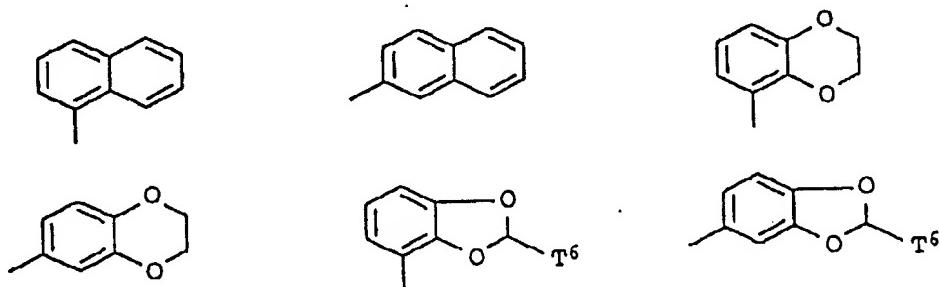


$T^1$ 、 $T^2$ 、 $T^3$ は、上記のように互いに独立にしている（但し、前記の基の1つだけはNO<sub>2</sub>であってもよい）

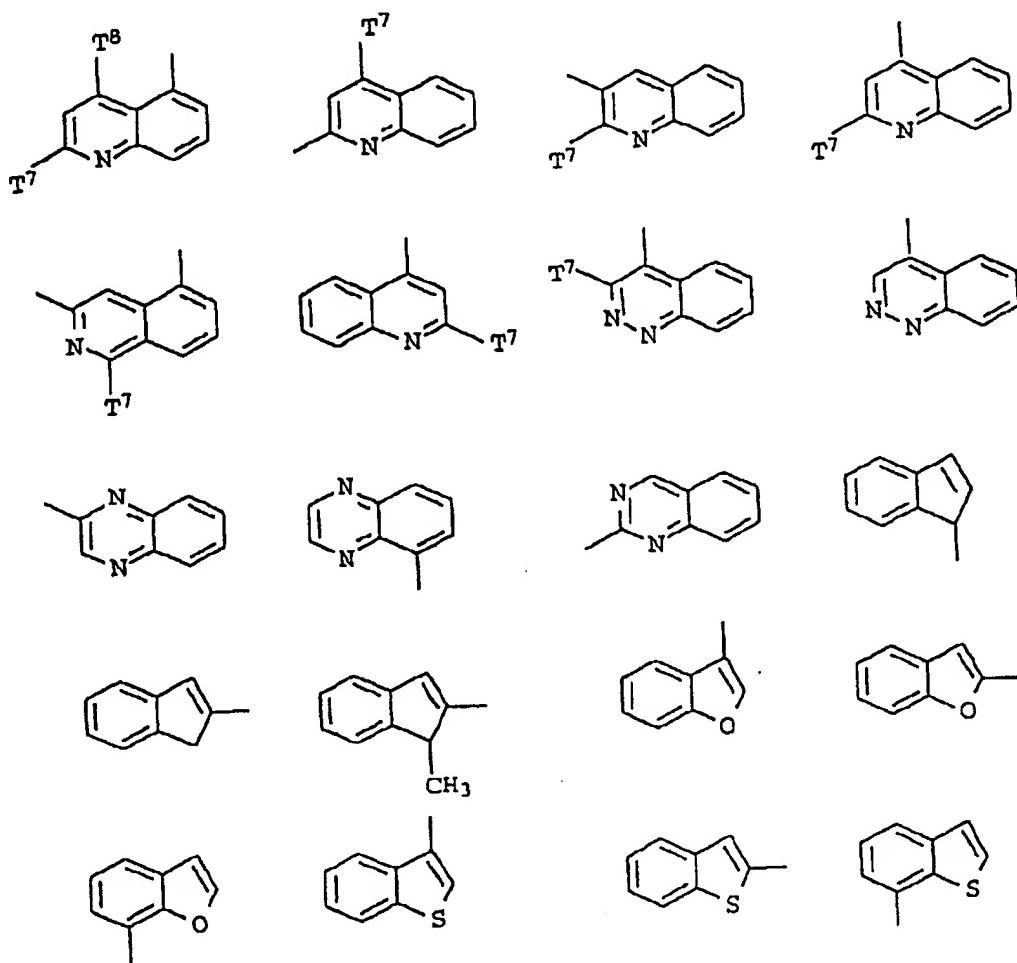


T<sup>4</sup> = H, F, Cl, Br, I, CF<sub>3</sub>, CH<sub>3</sub>, OH, OCH<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>,  
CN, NH<sub>2</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

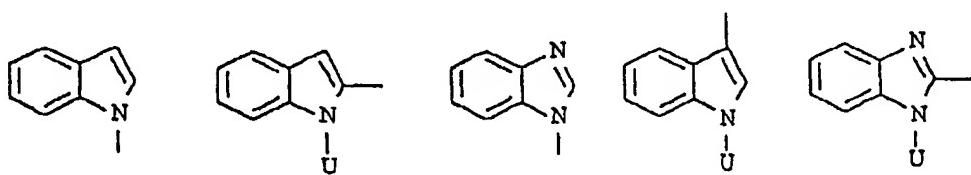
T<sup>5</sup> = H, F, Cl, Br, I, CF<sub>3</sub>, CH<sub>3</sub>, OH, OCH<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>,  
CN, NH<sub>2</sub>, N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

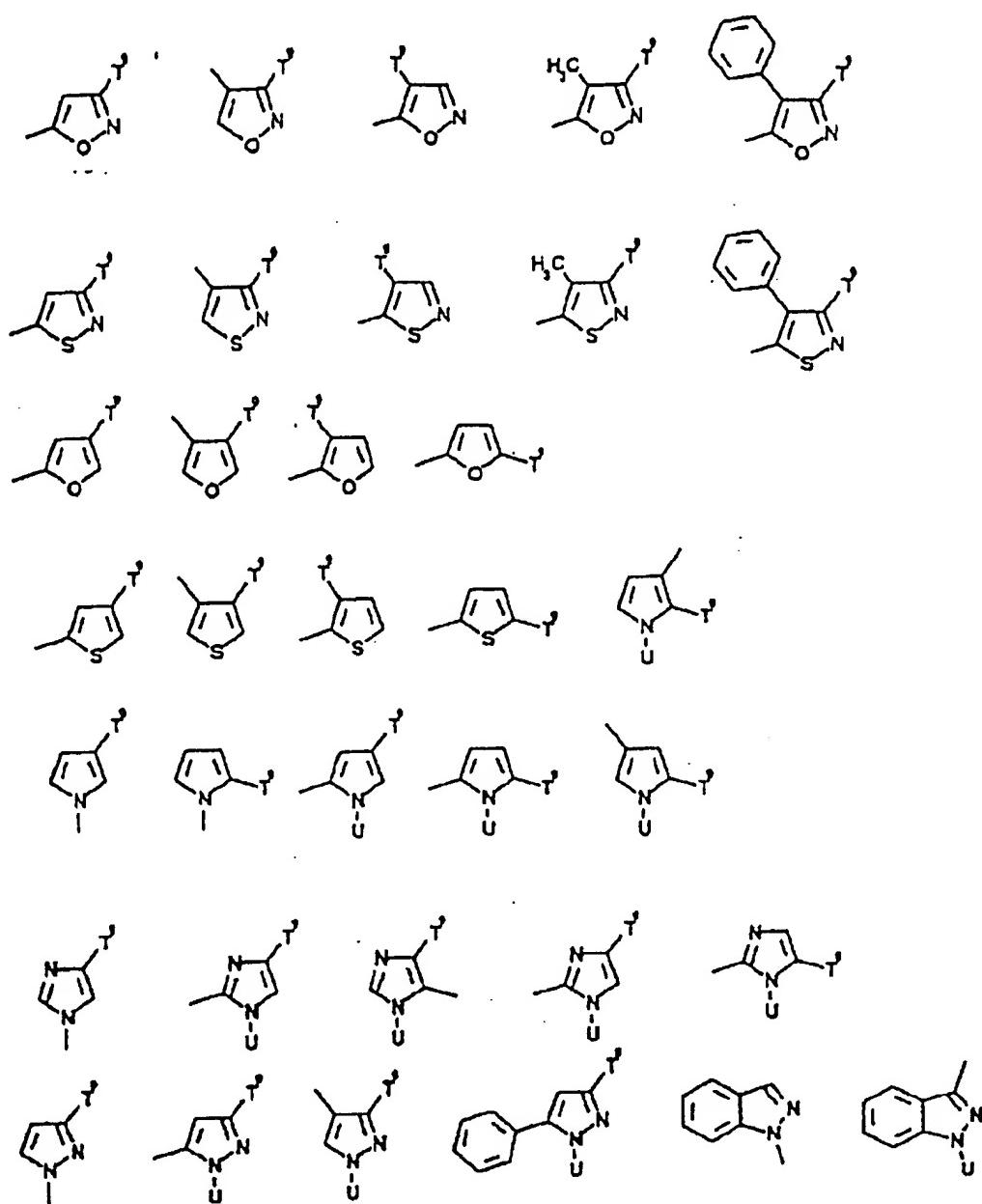


T<sup>6</sup> = H、メチル基、エチル基、n-ブロビル基、n-ブチル基、イソブロビル基、第三ブチル基、C F,

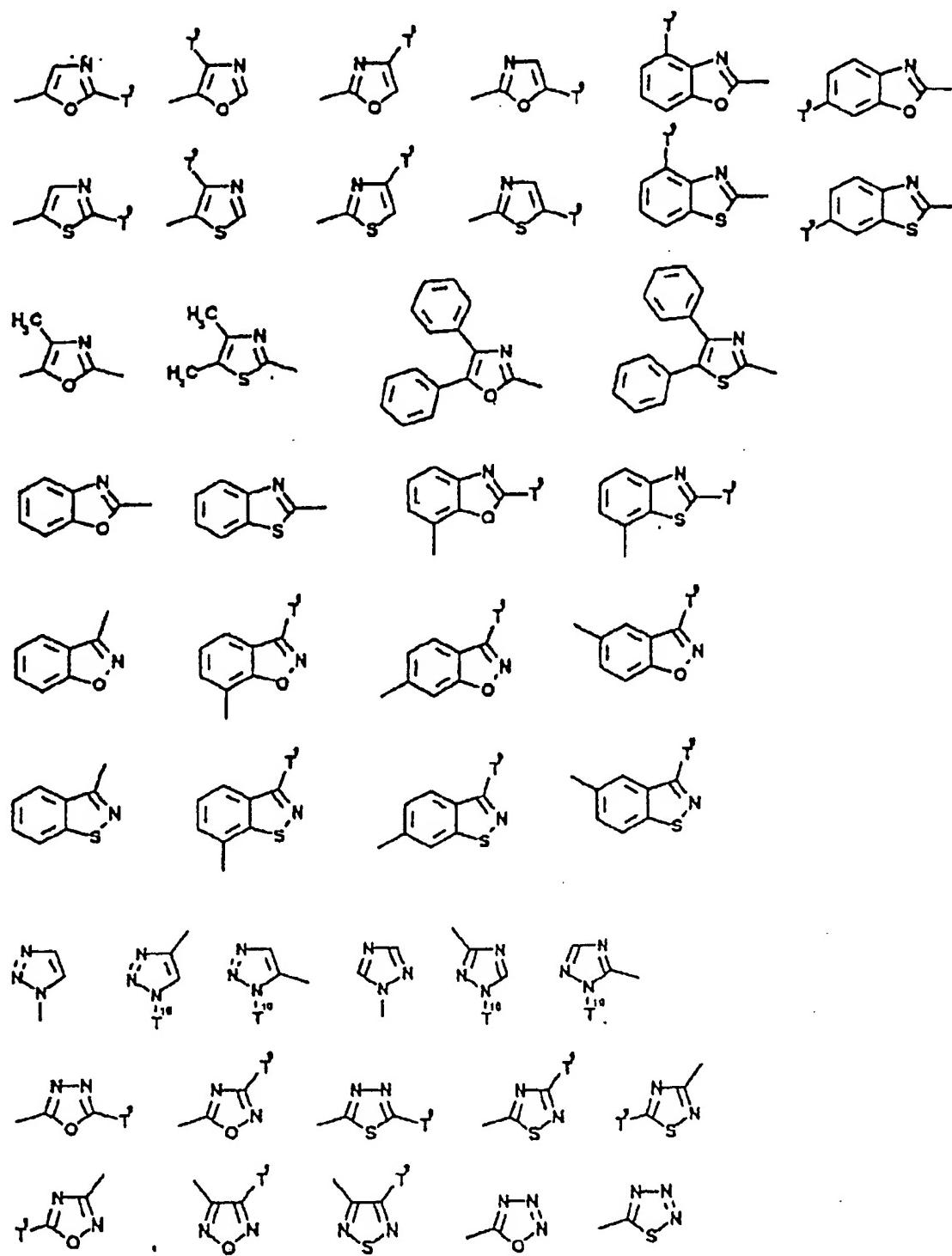


$T^7 = H$ 、メチル基、エチル基、n-ブロビル基、n-ブチル基、イソブロビル基、第三ブチル基、C F:



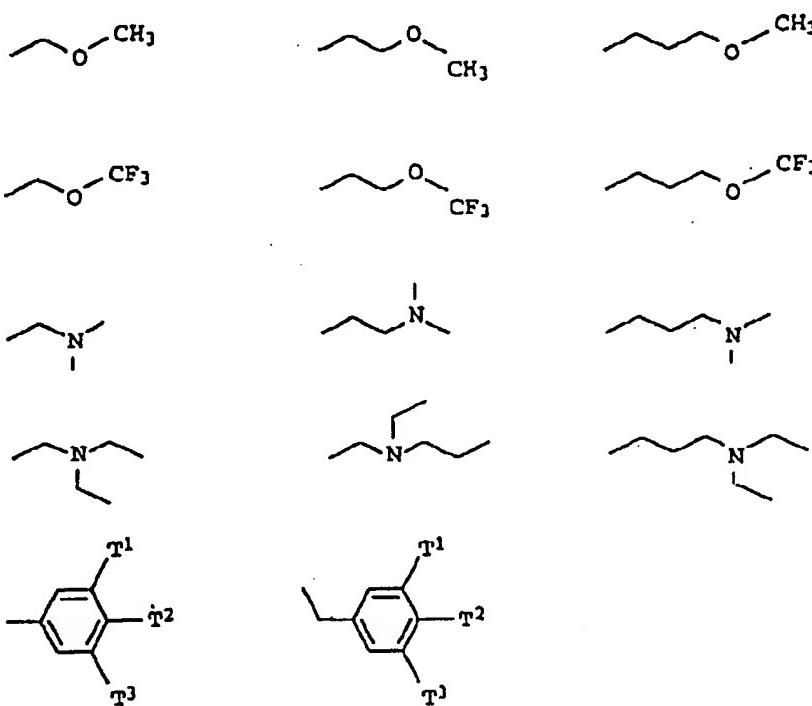


U = H, CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, ホルミル基、アセチル基、フェニル基、ベンジル基



全ての上記の基の  $T'$  = H、F、Cl、Br、J、メチル基、エチル基、n-ブロピル基、n-ブチル基、イソブロピル基、第三ブチル基、 $C_6F_5$ 、 $OCH_3$ 、 $N$  $O_2$ 、 $COOCH_3$ 、 $COOCH_2CH_3$ 、

$T''$  = メチル基、エチル基、ブロピル基、ブチル基、ベンジル基

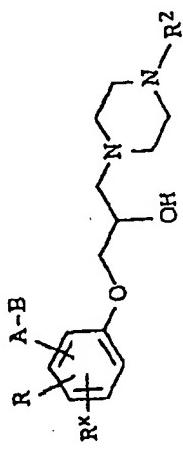


$\text{T}^1$ 、 $\text{T}^2$ 、 $\text{T}^3$ は、上記のように互いに独立にしている（但し、前記の基の1つだけはNO<sub>2</sub>であってもよい）

式1の詳細な例は、アミノヘテロ環の型によりZに分類される以下の構造を包含する：

(ローマ数字、例えばIIIを用いる記載された化合物および例の表示は、反応式I~VIII中に示される化合物の分類を参照する)

$Z = Z - 1$  を有するタイプIIIの詳細な例は次のものを包含する:



No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R'
III-1	ジベンズペラン-5-イル	2-E-ビニレン	3-メキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-2	ビス(4-メキシフェニル)-メチル	2-E-ビニレン	3-メキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-3	ジフェニルメチル	4-E-ビニレン	3-メキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-4	ジベンズペラン-5-イル	4-E-ビニレン	3-メキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-5	ジベンズペラン-5-イル	2-E-ビニレン	3-メチル-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-6	ジフェニルメチル	2-E-ビニレン	3-メチル-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-7	ジベンズペラン-5-イル	2-E-ビニレン	3-エキシカルボキシ-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-8	ジフェニルメチル	2-E-ビニレン	3-エキシカルボキシ-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-9	ジベンズペラン-5-イル	3-E-ビニレン	3-メキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-10	ジフェニルメチル	3-E-ビニレン	3-エキシカルボキシ-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-11	ジベンズペラン-5-イル	2-E-ビニレン	3-ソプロピル-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-12	ジフェニルメチル	2-E-ビニレン	3-フェニル-イソキサゾール-5-イル	H	H
III-13	ジベンズペラン-5-イル	2-E-ビニレン	3-7エニル-イソキサゾール-5-イル	H	H



例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R'
111-33	ジベソスベラン-5-1ル	2-B-ビニン	3-メキシメチル-イソキサソ-ル-5-1ル	4,5-ブタ-1,3-エノ-1,4-ジイソル	
111-34	ジベソスベラン-5-1ル	2-B-ビニン	3-メキシメチル-イソキサソ-ル-5-1ル	4-ケロル	H
111-35	ジフェニル-メチル	2-B-ビニン	3-ソブロビル-イソキサソ-ル-5-1ル	H	H
111-36	ジフェニル-メチル	2-B-ビニン	3-メチル-イソキサソ-ル-5-1ル	H	H
111-37	ジフェニル-メチル	2-B-ビニン	2-(4-メチシフェニル)-オキサソ-ル-4-1ル	H	H
111-38	ジベソスベラン-5-1ル	2-B-ビニン	2-(4-メチシフェニル)-オキサソ-ル-4-1ル	H	H
111-39	ジベソスベラン-5-1ル	2-B-ビニン	5-(4-メチルエニル)-1,3,4-オキシジアソ-ル-2-1ル	H	H
111-40	ジフェニル-メチル	2-B-ビニン	5-(4-メチルエニル)-1,3,4-オキシジアソ-ル-2-1ル	H	H
111-41	ジフェニル-メチル	2-B-ビニン	N-メチル-ビラジ-ル-4-1ル	H	H
111-42	ジフェニル-メチル	2-B-ビニン	3,5-ジメチル-1,3-オキサソ-ル-4-1ル	H	H
111-43	ジベソスベラン-5-1ル	2-B-ビニン	3,5-ジメチル-1,3-オキサソ-ル-4-1ル	H	H
111-44	ビス(4-フルオフェニル)-メチル	2-B-ビニン	3,5-ジメチル-1,3-オキサソ-ル-4-1ル	H	H
111-45	ジフェニル-メチル	2-B-ビニン	2-メチシメチル-チアソ-ル-4-1ル	H	H
111-46	ジベソスベラン-5-1ル	2-B-ビニン	2-メチシメチル-チアソ-ル-4-1ル	H	H
111-47	ビス(4-フルオフェニル)-メチル	2-B-ビニン	2-メチシメチル-チアソ-ル-4-1ル	H	H
111-48	ジフェニル-メチル	2-B-ビニン	チオフェン-2-1ル	H	H
111-49	ジフェニル-メチル	2-B-ビニン	チオフェン-3-1ル	H	H
111-50	ジフェニル-メチル	2-B-ビニン	5-メチル-1,3,4-チアジアソ-ル-2-1ル	H	H
111-51	2-(3,4-ジメチシフェニル)-エチル	2-B-ビニン	3-メキシメチル-オキサソ-ル-5-1ル	H	H
111-52	ジベソスベラン-5-1ル	2-B-ビニン	3-メキシメチル-オキサソ-ル-5-1ル	4-メタ	H

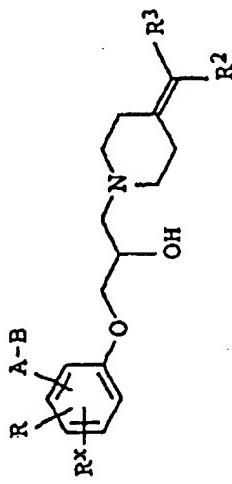
例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R'
111-53	ジフェニルメチル	2-B-Eニレノ	3-メキシメチル-1-オキサン-4-イリ	4-エト	H
111-54	ジフェニルメチル	2-B-Eニレノ	5-メキシメチル-1-オキサン-3-イリ	H	H
111-55	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	5-メキシメチル-1-オキサン-3-イリ	H	H
111-56	ビス(4-メキシフェニル)-メチル	2-B-Eニレノ	2-メキシメチル-チアノ-4-イリ	H	H
111-57	シクロヘキサ-2-エニメチル	2-B-Eニレノ	ビリジン-3-イリ	H	H
111-58	シクロヘキサ-2-エニメチル	2-B-Eニレノ	ビリジン-2-イリ	H	H
111-59	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	3-メキシメチル-1-オキサン-5-イリ	H	H
111-60	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	3-メチル-1-オキサン-5-イリ	H	H
111-61	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	3-イソプロピル-1-オキサン-5-イリ	H	H
111-62	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	3-エニカル-1-オキサン-5-イリ	H	H
111-63	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	3-エトキシカルボニル-1-オキサン-5-イリ	H	H
111-64	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	チオフェン-2-イリ	H	H
111-65	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	チオフェン-3-イリ	H	H
111-66	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	ビリジン-2-イリ	H	H
111-67	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	ビリジン-3-イリ	H	H
111-68	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	ビリジン-4-イリ	H	H
111-69	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	ビラゾール-2-イリ	H	H
111-70	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	ビラゾール-3-イリ	H	H
111-71	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	N-メチル-ビラゾール-3-イリ	H	H
111-72	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	フラン-2-イリ	H	H
111-73	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	フラン-3-イリ	H	H
111-74	ジベンズペラン-5-イリ	2-B-Eニレノ	3-メチル-1-オキサン-5-イリ	H	H

例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R'
111-75	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	3-1-1ロロタ-1-4キチソ-ル-5-1ル	H	H
111-76	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	3-2-2-1ル	H	H
111-77	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	3-エキシカルボキシ-1ソキソ-ル-5-1ル	H	H
111-78	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	チオフェン-2-1ル	H	H
111-79	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	チオフェン-3-1ル	H	H
111-80	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	ビリジン-2-1ル	H	H
111-81	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	ビリジン-3-1ル	H	H
111-82	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	ビリジン-4-1ル	H	H
111-83	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	ビラゾ-ル-2-1ル	H	H
111-84	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	ビラゾ-ル-3-1ル	H	H
111-85	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	N-メチルビラゾ-ル-2-1ル	H	H
111-86	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	N-メチルビラゾ-ル-3-1ル	H	H
111-87	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	ブラン-2-1ル	H	H
111-88	ジベソスベソ-5-1ル	2-2-2-1ル	ブラン-3-1ル	H	H
111-89	ジエニル-1ル	2-2-2-1ル	3-1キシナル-1ソキソ-ル-5-1ル	H	H
111-90	ジエニル-1ル	2-2-2-1ル	3-メチル-1ソキソ-ル-5-1ル	H	H
111-91	ジエニル-1ル	2-2-2-1ル	3-ソリプロピル-1ソキソ-ル-5-1ル	H	H
111-92	ジエニル-1ル	2-2-2-1ル	3-エニル-1ソキソ-ル-5-1ル	H	H
111-93	ジエニル-1ル	2-2-2-1ル	3-エキシカルボキシ-1ロキソ-ル-5-1ル	H	H
111-94	ジエニル-1ル	2-2-2-1ル	チオフェン-2-1ル	H	H
111-95	ジエニル-1ル	2-2-2-1ル	チオフェン-3-1ル	H	H
111-96	ジエニル-1ル	2-2-2-1ル	ビリジン-2-1ル	H	H

例 No.	R <sup>2</sup>	A	B	R	R'
111-97	ジフェニル-イチル	2-2-レニン	ピリジン-3-1ル	H	H
111-98	ジフェニル-メチル	2-2-レニン	ピリジン-4-1ル	H	H
111-99	ジフェニル-チル	2-2-レニン	ピロ-ハ-2-1ル	H	H
111-100	ジフェニル-メチル	2-2-レニン	ピラゾール-3-1ル	H	H
111-101	ジフェニル-イチル	2-2-レニン	N-メチル-ピラゾール-2-1ル	H	H
111-102	ジフェニル-チル	2-2-レニン	N-メチル-ピラゾール-3-1ル	H	H
111-103	ジフェニル-メチル	2-2-レニン	フラン-2-1ル	H	H
111-104	ジフェニル-イチル	2-2-レニン	フラン-3-1ル	H	H
111-105	ジフェニル-メチル	2-2-レニン	ピロ-ア-2-1ル	H	H
111-106	シクロヘキシル-フェニル-メチル	2-2-レニン	ピリジン-4-1ル	H	H
111-107	シクロヘキシル-フェニル-チル	2-2-レニン	N-メチル-ピロ-ア-2-1ル	H	H
111-108	ジフェニル-イチル	2-2-レニン	N-メチル-ピロ-ア-2-1ル	H	H
111-109	ジフェニル-チル	2-2-レニン	ピリジン-4-1ル	H	H
111-110	ジフェニル-チル	2-2-レニン	ピリジン-3-1ル	H	H
111-111	ジフェニル-イチル	2-2-レニン	ピリジン-2-1ル	H	H
111-112	(9H)-キサン-9-1ル-カ-ホキシ	2-2-レニン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-1ル	H	H
111-113	シロハキシル-7-ヒド-7セチル	2-2-レニン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-1ル	H	H
111-114	ジベンズペラソ-5-1ル	2-2-レニン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-1ル	6-7ル	H
111-115	ジフェニル-チル	2-2-レニン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-1ル	6-7ル	H
111-116	ジベンズペラソ-5-1ル	2-2-レニン	4-ジメチル-1, 3-オキサン-3-1ル	H	H
111-117	ジフェニル-イチル	2-2-レニン	4-ジメチル-1, 3-オキサン-3-1ル	H	H
111-142	ジベンズペラソ-5-1ル	2-2-レニン	3-トリフルオロメチル-イソキサゾール-5-1ル	H	H

No.	R <sub>2</sub>	A	B	R	R'
111-143	ジフェニル-アチル	2-E-ビニレン	3-トリフルオロメチル-イソキサン-1,4-ノ-5-1ル	H	H
111-144	ジベンズペラン-5-1ル	2-E-ビニレン	3-トリフルオロメチル-イソキサン-1,6-5-1ル	H	H
111-145	ビス(-4-フルオロフェニル)メチル	2-E-ビニレン	3-イソプロピル-イソキサン-1,6-5-1ル	H	H
111-146	ジフェニル-アセチル	2-E-ビニレン	3-イソプロピル-イソキサン-1,6-5-1ル	H	H
111-147	ジベンズペラン-5-1ル	2-E-ビニレン	3-メキシ-イソキサン-1,6-5-1ル	H	H
111-148	ジベンズペラン-5-1ル	2-E-ビニレン	3-メキシ-イソキサン-1,6-5-1ル	H	H
111-149	ジフェニル-アチル	2-E-ビニレン	3-メキシ-イソキサン-1,6-5-1ル	H	H
111-150	ジフェニル-アチル	2-E-ビニレン	3-メキシ-イソキサン-1,6-5-1ル	H	H
111-155	ジフェニル-アセチル	2-E-ビニレン	3-トリフルオロメチル-イソキサン-1,6-5-1ル	H	H
111-156	ビス(4-フルオロフェニル)メチル	2-E-ビニレン	3-トリフルオロメチル-イソキサン-1,6-5-1ル	H	H
111-157	ジフェニル-アセチル	2-E-ビニレン	2-メキシメチル-チアノ-1,6-4-1ル	H	H
111-158	ジベンズペラン-5-1ル	2-E-ビニレン	2-メキシメチル-1,3,4-トリフルオロ-1,6-5-1ル	H	H
111-159	ジフェニル-アチル	2-E-ビニレン	2-メキシメチル-1,3,4-トリフルオロ-1,6-5-1ル	H	H
111-160	ジフェニル-アセチル	2-E-ビニレン	2-メキシメチル-1,3,4-トリフルオロ-1,6-5-1ル	H	H
111-161	ジベンズペラン-5-1ル	2-E-ビニレン	2-メキシメチル-1,3,4-トリフルオロ-1,6-5-1ル	H	H
111-162	ビス(4-フルオロフェニル)メチル	2-E-ビニレン	2-メキシメチル-1,3,4-トリフルオロ-1,6-5-1ル	H	H
111-163	シロヘキシル-フェニル-アセチル	2-E-ビニレン	2-メキシメチル-1,3,4-トリフルオロ-1,6-5-1ル	H	H

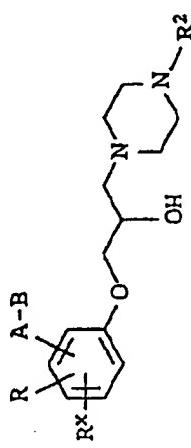
$Z = Z - 2$  を有するタイプ III の詳細な例は次のものを包含する：



例 No.	$R^2 = R^3$	A	B	R	$R^*$
III-118	フェニル	2-B-ビニン	3-メキシメチル-イソキサゾル-5-イル	H	H
III-119	フェニル	4-B-ビニン	3-メキシメチル-イソキサゾル-5-イル	H	H
III-120	フェニル	2-B-ビニン	3-メチル-イソキサゾル-5-イル	H	H
III-121	フェニル	2-B-ビニン	3-エキシカルボキシ-イソキサゾル-5-イル	H	H
III-122	フェニル	3-B-ビニン	3-メキシメチル-イソキサゾル-5-イル	H	H
III-123	フェニル	2-B-ビニン	3-イソプロピル-イソキサゾル-5-イル	H	H
III-124	フェニル	2-B-ビニン	3-フェニル-イソキサゾル-5-イル	H	H
III-125	フェニル	2-Z-ビニン	3-メキシメチル-イソキサゾル-5-イル	H	H
III-126	フェニル	2-Z-ビニン	3-メキシメチル-イソキサゾル-5-イル	H	H
III-127	フェニル	2-B-ビニン	3-メキシメチル-イソキサゾル-5-イル	5-ジエチルアミノ	H
III-128	フェニル	2-B-ビニン	3-メキシメチル-イソキサゾル-5-イル	4, 5-ジメトキシ	
III-129	フェニル	2-B-ビニン	3, 5-ジメチル-イソキサゾル-4-イル	H	H
III-130	フェニル	2-B-ビニン	3-メキシメチル-イソキサゾル-5-イル	4-ニトロ	H

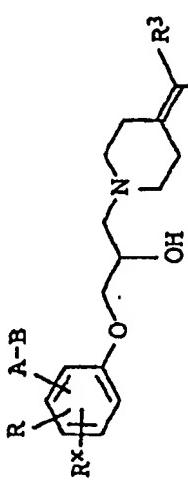
例	$R^2 = R^3$	A	B	R	$R^*$
III-131	フェニル	2-B-ビニン	3-メキシメチル-4-キサゾール-5-イソ	6-ブロム	H
III-132	フェニル	2-B-ビニン	4-ジメチル-1,3-オキサン-2-イソ	H	H
III-151	フェニル	2-B-ビニン	5-メキシメチル-4-キサゾール-3-イソ	H	H
III-152	フェニル	2-B-ビニン	3,5-ジメチル-4-キサゾール-4-イソ	H	H
III-162	フェニル	2-B-ビニン	トリアフルオロメチル-4-キサゾール-5-イソ	H	H
III-163	フェニル	2-B-ビニン	2-メキシメチル-4-キサゾール-4-イソ	H	H
III-164	フェニル	2-B-ビニン	2-メキシメチル-1,3,4-トリヒドロ-5-イソ	H	H

$Z = Z - 1$  を有するタイプ III の詳細な例は次のものを包含する:



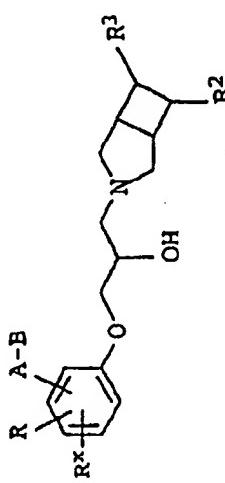
例	$R^2$	A	B	$R = R^*$
III-133	ジベンズペラノ-5-イソ	2-B-(メチル)-ビニン	3-メキシメチル-4-キサゾール-5-イソ	H
III-134	ジベンズペラノ-5-イソ	2-Z-(メチル)-ビニン	3-メキシメチル-4-キサゾール-5-イソ	H
III-135	ジフェニル-メチル	2-B-(メチル)-ビニン	3-メキシメチル-4-キサゾール-5-イソ	H
III-136	ジフェニル-メチル	2-Z-(メチル)-ビニン	3-メキシメチル-4-キサゾール-5-イソ	H

$Z = Z - 2$  を有するタイプ III の詳細な例は次のものを包含する：



例	$R^2 = R^3$	A	B	$R = R'$
III-137	7-ニトロ	2-ブチル-(4-ブチル)-ピリジン	3-メキシチル-イソキサゾール-5-イソ	H
III-138	7-ニトロ	2-2-(3-ブチル)-ピリジン	3-メキシチル-イソキサゾール-5-イソ	H

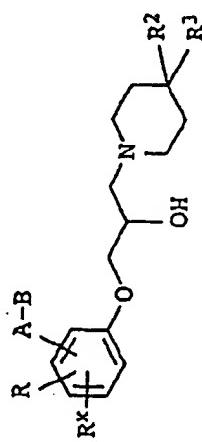
$Z = Z - 3$  を有するタイプ III の詳細な例は次のものを包含する：



例	$R^2$	$R^3$	A	B	$R$	$R'$
III-139	6-ブチル	7-ブチル	2-ブチル	3-メキシチル-イソキサゾール-5-イソ	H	H
III-140	(4-フルオロ-7-エニル)	H	2-ブチル	3-メキシチル-イソキサゾール-5-イソ	H	H

例	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	A	B	R	R'
III-141	4-第三アチル-フェニル	H	2-B-ビニレン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	3, 4-ブジエノ-	
III-153	6-フェニル	7-フェニル	2-B-ビニレン	3-イソプロピル-イソキサゾール-5-イル	H	1, 4-ジメチル
III-154	4-第三アチル-フェニル	H	2-B-ビニレン	5-メトキシメチル-イソキサゾール-3-イル	H	H

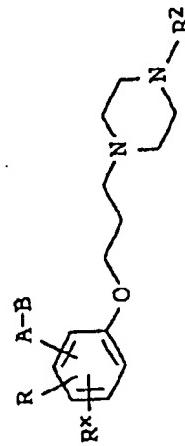
Z = Z - 4 を有するタイプ IIII の詳細な例は次のものを包含する :



例	R <sup>2</sup> = R <sup>3</sup>	A	B	R = R'
III-165	7-エニル	2-B-ビニレン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-166	7-エニル	2-Z-ビニレン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-167	7-エニル	3-B-ビニレン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-168	7-エニル	3-Z-ビニレン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-169	7-エニル	4-B-ビニレン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-170	7-エニル	4-Z-ビニレン	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H

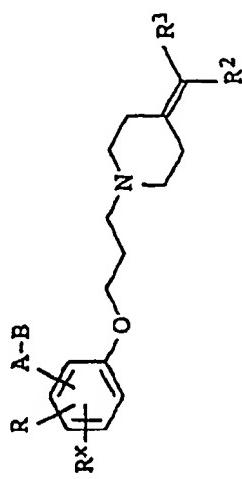
例	$R^2 + R^3$	A	B	$R = R'$
III-171	ジベンソスベラン-5-イリデン	2-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-172	ジベンソスベラン-5-イリデン	2-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-173	ジベンソスベラン-5-イリデン	3-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-174	ジベンソスベラン-5-イリデン	3-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-175	ジベンソスベラン-5-イリデン	4-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-176	ジベンソスベラン-5-イリデン	4-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-177	ジベンソスベラン-5-イリデン	2-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-178	ジベンソスベラン-5-イリデン	2-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
III-179	ジベンソスベラン-5-イリデン	2-E-ビニル	2-メチルキシアツヨーロ-4-イル	H

$Z = Z - 1$  を有するタイプIVの詳細な例は次のものを包含する：



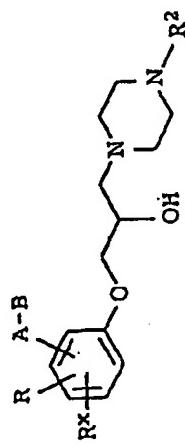
例	$R^2$	A	B	$R = R'$
IV-1	ジフェニル-4-チル	2-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
IV-2	ジベンソスベラン-5-イル	2-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
IV-3	ジフェニルセチル	2-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
IV-4	シクロヘキシル-フェニル-4-チル	2-E-ビニル	3-メトキシメチル-イソキサゾール-5-イル	H

$Z = Z - 2$  を有するタイプ IV の詳細な例は次のものを包含する:



例	$R^z$	A	B	$R = R'$
IV-5	フェニル	2- <i>B</i> -ビニル	3- <i>トキシ</i> チル-イソキサゾール-5-イル	H
IV-6	フェニル	2- <i>Z</i> -ビニル	3- <i>トキシ</i> チル-イソキサゾール-5-イル	H
IV-7	フェニル	3- <i>B</i> -ビニル	3- <i>トキシ</i> チル-イソキサゾール-5-イル	H
IV-8	フェニル	3- <i>Z</i> -ビニル	3- <i>トキシ</i> チル-イソキサゾール-5-イル	H
IV-9	フェニル	4- <i>B</i> -ビニル	3- <i>トキシ</i> チル-イソキサゾール-5-イル	H
IV-10	フェニル	4- <i>Z</i> -ビニル	3- <i>トキシ</i> チル-イソキサゾール-5-イル	H

Z = Z - 1 を有するタイプ V の詳細な例は次のものを包含する：

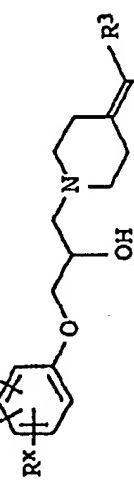


例	R <sup>2</sup>	A	B	R = R'
V-1	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシ	3-メチルキシチル-1-キサ-1-ル-5-イル	H
V-2	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシチレン	3-メチルキシチル-1-キサ-1-ル-5-イル	H
V-3	ジフェニルメチル	2-メチルオキシチリジ	3-メチルキシチル-1-キサ-1-ル-5-イル	H
V-4	ジフェニルメチル	2-メチルオキシ	3-メチルキシチル-1-キサ-1-ル-5-イル	H
V-5	シクロヘキシル-フェニル-メチル	2-メチルオキシ	3-メチルキシチル-1-キサ-1-ル-5-イル	H
V-6	ジフェニルメチル	2-メチルオキシ	3-メチル-1-キサ-1-ル-5-イル	H
V-7	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシ	3-メチル-1-キサ-1-ル-5-イル	H
V-8	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシ	3-メチルプロピル-1-キサ-1-ル-5-イル	H
V-9	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシ	3-フェニル-1-キサ-1-ル-5-イル	H
V-10	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシ	3-エトキシカルボキシ-1-キサ-1-ル-5-イル	H
V-11	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシ	チオフェン-2-イル	H
V-12	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシ	チオフェン-3-イル	H
V-13	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシ	ビリジン-2-イル	H
V-14	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシ	ビリジン-3-イル	H
V-15	ジベンゾスペラン-5-イル	2-メチルオキシ	ビリジン-4-イル	H

例	R <sup>3</sup>	A	B	R = R <sup>*</sup>
V-16	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	ビラート-ル-2-1ル	H
V-17	ジベンゾスベラン-5-1ル	メチレンオキシ	ビラト-ル-3-1ル	H
V-18	ジベンゾスベラン-5-1ル	メチレンオキシ	N-メチルビラゾ-ル-2-1ル	H
V-19	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	フラン-2-1ル	H
V-20	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	フラン-3-1ル	H
V-21	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	3-メチル-1-ソチナ-1-ル-5-1ル	H
V-22	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	3-メチル-1-ソチナ-1-ル-5-1ル	H
V-23	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	3-メチルプロピレ-1-ソチナ-1-ル-5-1ル	H
V-24	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	3-フェニル-1-ソチナ-1-ル-5-1ル	H
V-25	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	3-エキシカルボキシ-1-ソチナ-1-ル-5-1ル	H
V-26	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	チオフェン-2-1ル	H
V-27	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	チオフェン-3-1ル	H
V-28	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	ピリジン-2-1ル	H
V-29	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	ピリジン-3-1ル	H
V-30	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	ピリジン-4-1ル	H
V-31	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	ピラゾ-ル-2-1ル	H
V-32	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	ピラゾ-ル-3-1ル	H
V-33	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	N-メチルビラゾ-ル-2-1ル	H
V-34	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	N-メチルビラゾ-ル-3-1ル	H
V-35	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	フラン-2-1ル	H
V-36	ジベンゾスベラン-5-1ル	2-メチレンオキシ	フラン-3-1ル	H
V-37	ジフェニル-メチル	2-メチレンオキシ	3-フェニル-1-ソチナ-1-ル-5-1ル	H

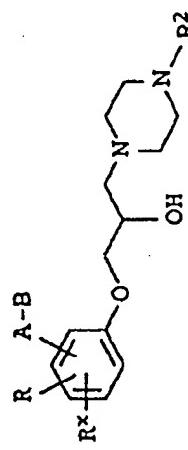
例	R <sup>2</sup>	A	B	R = R'
V-38	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	3-エトキシカルボキシカーボキサツル-5-イル	H
V-39	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	チオフェン-2-イル	H
V-40	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	チオフェン-3-イル	H
V-41	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	ビリジン-2-イル	H
V-42	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	ビリジン-3-イル	H
V-43	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	ビリジン-4-イル	H
V-44	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	ピラゾール-2-イル	H
V-45	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	ピラゾール-3-イル	H
V-46	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	N-メチルピラゾール-2-イル	H
V-47	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	N-メチルピラゾール-3-イル	H
V-48	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	フラン-2-イル	H
V-49	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	フラン-3-イル	H
V-50	フェニル	2-メチレンオキシ	3-メトキシトルイソキサツル-5-イル	H
V-51	フェニル	2-メチレンオキシチレン	3-メトキシトルイソキサツル-5-イル	H
V-52	ジフェニルーメチル	2-メチレンオキシ	3-イソプロピルオキサツル-5-イル	H

Z = Z - 2 を有するタイプ V の詳細な例は次のものを包含する :



例	R <sup>2</sup> = R <sup>3</sup>	A	B	R = R
V-53	フェニル	2-メチレンオキシ	3-メチシメチル-イソキサゾール-5-イル	H
V-54	フェニル	2-メチレンオキシメチジン	3-メチシメチル-イソキサゾール-5-イル	H

Z = Z - 1 を有するタイプ VI の詳細な例は次のものを包含する :



例	R <sup>2</sup>	A	B	R = R
VI-1	ジフェニル-メチル	2-エチレン	4,5-ジメチル-オキサゾール-2-イル	H
VI-2	ジベンソスベラゾール-5-イル	2-エチレン	3-メトキシメチル-イソキサン-2-5-イル	H
VI-3	ジフェニル-メチル	2-エチレン	3-メトキシメチル-イソキサン-2-5-イル	H
VI-4	ジフェニル-アセチル	2-エチレン	3-メトキシメチル-イソキサン-2-5-イル	H
VI-5	シクロヘキシル-フェニル-メチル	2-エチレン	3-メトキシメチル-イソキサン-2-5-イル	H